

(12) DEMANDE INTERNATIONALE PUBLIÉE EN VERTU DU TRAITÉ DE COOPÉRATION
EN MATIÈRE DE BREVETS (PCT)

(19) Organisation Mondiale de la Propriété
Intellectuelle
Bureau international



(43) Date de la publication internationale
7 avril 2005 (07.04.2005)

PCT

(10) Numéro de publication internationale
WO 2005/030238 A1

(51) Classification internationale des brevets⁷ :
A61K 38/00, C07K 14/00, A61P 35/00

(21) Numéro de la demande internationale :
PCT/FR2004/002422

(22) Date de dépôt international :
24 septembre 2004 (24.09.2004)

(25) Langue de dépôt : français

(26) Langue de publication : français

(30) Données relatives à la priorité :
0311270 25 septembre 2003 (25.09.2003) FR

(71) Déposant (pour tous les États désignés sauf US) : THER-
APTOSIS [FR/FR]; Pasteur Bio Top, 25, rue du Docteur
Roux, F-75015 Paris (FR).

(72) Inventeurs; et

(75) Inventeurs/Déposants (pour US seulement) : JACOTOT,
Etienne [FR/FR]; 171, rue Lecourbe, F-75015 Paris (FR).

BORGNE-SANCHEZ, Annie [FR/FR]; 10, rue de Bu-
dapest, F-75009 Paris (FR). DUPONT, Sylvie [FR/FR];
225/227, rue de la Croix Nivert, F-75015 Paris (FR). RE-
BOUILLAT, Dominique [FR/FR]; 36, rue du Hameau,
F-75015 Paris (FR).

(74) Mandataires : PEAUCELLE, Chantal etc.; CABINET
ARMENGAUD AINE, 3, avenue Bugeaud, F-75116 Paris
(FR).

(81) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre de
protection nationale disponible) : AE, AG, AL, AM, AT,
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO,
CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB,
GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG,
KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG,
MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH,
PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN,
TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) États désignés (sauf indication contraire, pour tout titre
de protection régionale disponible) : ARIPO (BW, GH,
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,
ZW), eurasién (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),

[Suite sur la page suivante]

(54) Title: PEPTIDES HAVING, FOR EXAMPLE, AN ANTIANGIOGENIC ACTIVITY AND APPLICATIONS THEREOF IN
THERAPEUTICS

(54) Titre : PEPTIDES POSSEDANT NOTAMMENT UNE ACTIVITE ANTI-ANGIOGENIQUE ET LEURS APPLICATIONS
EN THERAPEUTIQUE

(57) Abstract: The invention relates to cyclised peptides corresponding to sequence SEQ ID N°1:
X₁X₂RGDX₃FGX₄X₅LLFIHFX₆IGSX₇HSX₈IX₉, wherein: the letters without any numerical index correspond to amino acids
defined by the single-letter international code; X₁ is G or GG having an amino-terminal end which may or may not be free; X₂ is
either a C, in which case X₂ = X₄, the two Cs being connected by a disulphide bridge, or X₂ is capable of forming a lactam
bridge with X₄, either X₂ or X₄ being an amino acid bearing an acid group, such as A or D, and the other bearing an amino
function such as Q, N; X₃ is either an M pattern or a norleucine pattern; X₅ is one or several di-, tri-, or tetra-peptide patterns
comprising G or a combination of G and S, or X₅ is a C pattern having a side-chain which serves as a covalent linkage point with a
3-nitro-2-pyridinesulphenyl group which is located at the N-terminal end of the next amino acid (L); X₆ is either an R pattern or a
K pattern; X₇ is either an R pattern or a K pattern; X₈ is either an R pattern or a K pattern; and X₉ is an aliphatic amino acid (such as
G or A) having an amide C-terminal end. The inventive peptides can be used as active ingredients in medicaments, for example, for
the treatment of pathologies linked to hypervascularisation.

(57) Abrégé : L'invention vise des peptides cyclisés, répondant à la séquence : SEQ ID N°1 :
X₁X₂RGDX₃FGX₄X₅LLFIHFX₆IGSX₇HSX₈IX₉, dans laquelle : - les lettres sans indice numérique correspondent aux acides
aminés définis par le code international à une lettre. - X₁ est G ou GG dont l'extrémité amino-terminale est libre ou non, - X₂ est
soit un C, auquel cas X₂ = X₄, les 2 C étant alors réunis par un pont disulfure, ou X₂ est capable de former un pont lactame avec X₄,
l'un de X₂ ou X₄ étant un acide aminé porteur d'un groupement acide, comme A ou D, l'autre portant une fonction aminée, comme
Q, N. - X₃ est soit un motif M, soit un motif nor-Leucine. - X₅ est un ou plusieurs motifs di- tri- ou tetra-peptidiques composés de
G ou d'une combinaison de G et de S, ou encore X₅ est un motif C dont la chaîne latérale sert de point de liaison covalente avec un
groupe 3-nitro-2-pyridinesulfényle situé sur l'extrémité N-terminale de l'acide aminé suivant (L). - X₆ est soit un motif R, soit un
motif K. - X₇ est soit un motif R, soit un motif K. - X₈ est soit un motif R, soit un motif K. - X₉ est un acide aminé aliphatique
(comme G, ou A) dont l'extrémité C-terminale est amidée. Ces peptides sont utilisables comme principes actifs de médicaments,
notamment pour le traitement de pathologies liées à une hyper-vascularisation.

WO 2005/030238 A1



européen (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Publiée :

— avec rapport de recherche internationale

— avant l'expiration du délai prévu pour la modification des revendications, sera republiée si des modifications sont reçues

En ce qui concerne les codes à deux lettres et autres abréviations, se référer aux "Notes explicatives relatives aux codes et abréviations" figurant au début de chaque numéro ordinaire de la Gazette du PCT.